

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2002 年 12 月 5 日 (05.12.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/096882 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 231/14, 213/81,
285/06, 239/28, 307/68, 277/56, 261/18, 275/02, 333/40,
207/416, 213/82, 333/38, C07C 211/52, 215/68, 217/76,
A01N 37/22, 43/40, 43/56

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/05285

(22) 国際出願日: 2002 年 5 月 30 日 (30.05.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

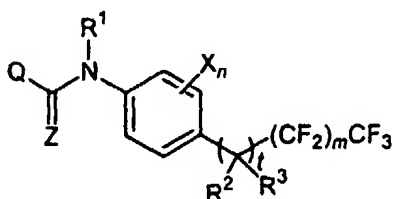
(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2001-164787 2001 年 5 月 31 日 (31.05.2001) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本農業
株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒
103-8236 東京都中央区日本橋 1 丁目 2 番 5 号 Tokyo
(JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 古谷 敬
(FURUYA, Takashi) [JP/JP]; 〒 598-0021 大阪府 泉
佐野市 日根野 2821-1 Osaka (JP). 山口 実 (YAM-
AGUCHI, Minoru) [JP/JP]; 〒 589-0008 大阪府 大阪
狭山市 池尻自由丘 1-4-3-402 Osaka (JP). 遠西 正範
(TOHNISHI, Masanori) [JP/JP]; 〒 599-8241 大阪府 堺
市 福田 1040-1-408 Osaka (JP). 瀬尾 明 (SEO, Akira)
[JP/JP]; 〒 648-0092 和歌山県 橋本市 紀見ヶ丘 2-3-19
Wakayama (JP). 森本 雅之 (MORIMOTO, Masayuki)[JP/JP]; 〒 586-0024 大阪府 河内長野市 西之山町
1-28-305 Osaka (JP). 竹元 剛 (TAKEMOTO, Tsuyoshi)
[JP/JP]; 〒 586-0024 大阪府 河内長野市 西之山町
1-28-402 Osaka (JP). 藤岡 伸祐 (FUJIOKA, Shinsuke)
[JP/JP]; 〒 586-0037 大阪府 河内長野市 上原町
474-1-103 Osaka (JP).(74) 代理人: 浅村 皓, 外 (ASAMURA, Kiyoshi et al.); 〒
100-0004 東京都千代田区大手町 2 丁目 2 番 1 号 新
大手町ビル 3 3 1 Tokyo (JP).(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU,
LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM,
PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN,
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特
許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).添付公開書類:
— 国際調査報告書2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。(54) Title: SUBSTITUTED ANILIDE DERIVATIVES, INTERMEDIATES THEREOF, AGRICULTURAL AND HORTICUL-
TURAL CHEMICALS, AND THEIR USAGE

(54) 発明の名称: 置換アニリド誘導体、その中間体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法



(I)

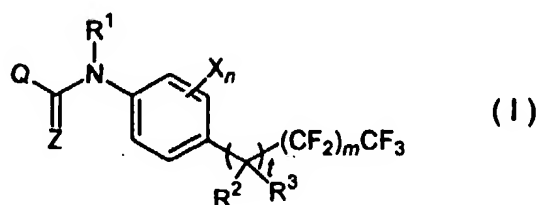
(57) Abstract: Substituted anilide derivatives represented by the
general formula (I), intermediates thereof, agricultural and horti-
cultural chemicals, and their usage: (I) wherein R¹ is hydrogen,
C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, or the like; R² is hydrogen, halogeno, or
C₁₋₆ haloalkyl; R³ is hydrogen, halogeno, C₁₋₆ alkyl, or the like;
t is 0 or 1; m is an integer of 0 to 6; when t is 0, X is C₂₋₈ alkyl,
C₁₋₈ alkoxy, or the like, while when t is 1, X is halogeno, cyano,
or the like; n is an integer of 1 to 4; Z is O or S; and Q is Q1 to
Q25.

[続葉有]



(57) 要約:

本発明は、一般式(I)



(式中、 R^1 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基等を示し； R^2 は水素原子、ハロゲン原子又はハロ C_1 - C_6 アルキル基を示し； R^3 は水素原子、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基等を示し； t は0又は1を示し； m は0～6の整数を示し； t が0のとき X は C_2 - C_8 アルキル基、 C_1 - C_8 アルコキシ基等を示し、 t が1のとき X はハロゲン原子、シアノ基等を示し； n は1～4の整数を示し； Z はO又はSを示し； Q は $Q1$ ～ $Q25$ を示す)

で表される置換アニリド誘導体、その中間体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法に関するものである。

明 細 書

置換アニリド誘導体、その中間体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法

5 技術分野

本発明は置換アニリド誘導体、その中間体及び該化合物を有効成分とする農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤、殺菌剤又は殺ダニ剤並びにその使用方法に関するものである。

背景技術

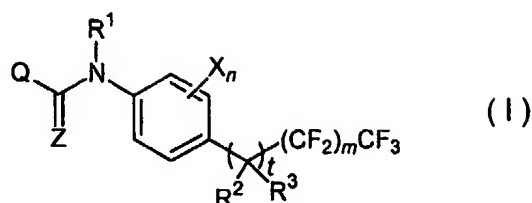
- 10 特開平 5-221994 号公報や、特開平 10-251240 号公報に本発明の置換アニリド誘導体に類似した化合物が農園芸用殺菌剤として有用であることが記載されている。

- 農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤の開発が望まれている。又、就農者の高齢化等により各種の省力的施用方法が求められるとともに、これらの施用方法に適した性格を有する農園芸用薬剤の創出が求められている。

発明の開示

- 本発明者等は新規な農園芸用薬剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明の一般式 (II) で表される置換アニリン誘導体が文献未記載の新規化合物であり、該化合物は医薬、農薬等の生理活性を有する各種誘導体を製造する上で有用な中間体であることを見だし、更に該化合物から誘導される一般式 (I) で表される置換アニリド誘導体が文献未記載の新規化合物であり、農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫、殺菌又は殺ダニ剤として有用であることを見だし、本発明を完成させたものである。

即ち、本発明は一般式 (I)



{式中、 R^1 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

R^2 は水素原子、ハロゲン原子又はハロ C_1 - C_6 アルキル基を示す。

R^3 は水素原子、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_3 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_3 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ C_1 - C_3 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ C_1 - C_3 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル C_1 - C_3 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル C_1 - C_3 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_3 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_3 アルコキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ C_1 - C_3 アルコキシ基、同一又は異なっても良い C_1 - C_6 アルキルアミノ C_1 - C_3 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1 - C_6 アルキルアミノ基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 ア

- ルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、
- 10 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、
- 15 ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、フェニルC₁-C₆アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキル
- 20
- 25

スルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシ基を示す。

- 5 t は0または1を示し、 m は0～6の整数を示す。

t が0のとき、 X は同一又は異なっても良く、 C_2-C_8 アルキル基、 C_1-C_8 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基又は同一若しくは異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基を示し、 n は1～4の整数を示す。

- 10 t が1のとき、 X は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 C_1-C_8 アルキル基、ハロ C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、ハロ C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、ハロ C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_3-C_6 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_8 アルコキシ基、ハロ

- 15 C_1-C_8 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基、 C_1-C_8 アルキルカルボニル基、ハロ C_1-C_8 アルキルカルボニル基、 C_1-C_8 アルキルチオカルボニル基、ハロ C_1-C_8 アルキルチオカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6

- 20 C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6

- アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
- 5 C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示し、nは1～
- 25 4の整数を示す。

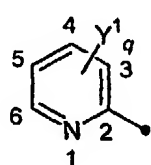
又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキ

ルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、XはR¹と結合して、1～2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5～8員環を形成することができる。

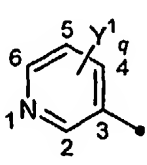
Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。

QはQ1～Q25で表される置換基を示す。

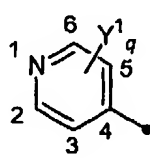
10



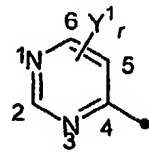
Q1



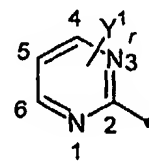
Q2



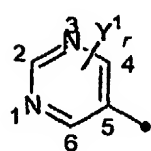
Q3



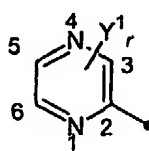
Q4



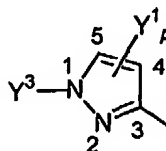
Q5



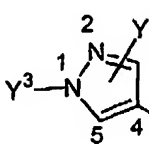
Q6



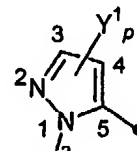
Q7



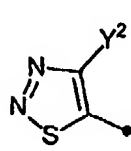
Q8



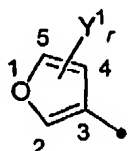
Q9



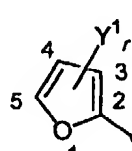
Q10



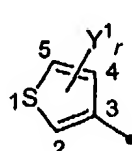
Q11



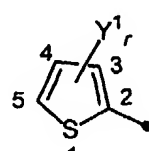
Q12



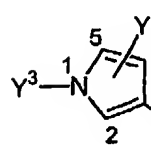
Q13



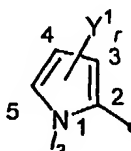
Q14



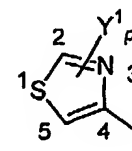
Q15



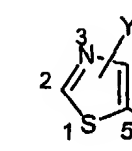
Q16



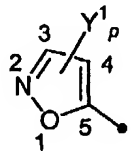
Q17



Q18

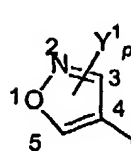


Q19

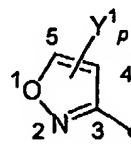


Q20

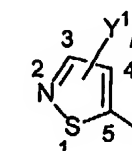
15



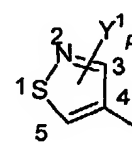
Q21



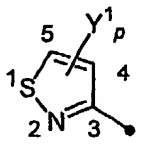
Q22



Q23



Q24



Q25

(式中、Y¹は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、

C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₂-C₆アルケニル基、ハロC₂-C₆アルケニル基、C₂-C₆アルキニル基、ハロC₂-C₆アルキニル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

又、芳香環上の隣接した2個のY¹は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、

C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

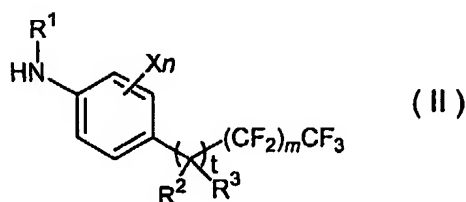
Y^2 は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6

アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

- 5 Y³は水素原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。
- 10

pは0～2の整数を示し、qは0～4の整数を示し、rは0～3の整数を示す。)を示す。}

- 15 で表される置換アニリド誘導体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法に関するものであり、更には置換アニリド誘導体を製造するための中間体化合物である一般式(II)



- (式中、R¹は水素原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ
- 20
- 25 基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

R^2 は水素原子、ハロゲン原子又はハロ C_1-C_6 アルキル基を示す。

- R^3 は水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ基、
- 5 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシ基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルコキシ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキル
- 10 アミノ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
- 15 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシ
- 20 カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスル
- 25 ホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6

- アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、フェニル C_1-C_6 アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシ基を示す。

tは1を示し、mは0から6の整数を示す。

- Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 C_1-C_8 アルキル基、ハロ C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、ハロ C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、ハロ C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_3-C_6 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_8 アルコキシ基、ハロ C_1-C_8 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基、 C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-

- C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルキル基、モノC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₆アルキル基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₆アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示し、nは1~4の整数を示す。

- 又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。)で表される置換アニリン誘導体に関するものである。

発明を実施するための形態

- 本発明の置換アニリド誘導体の一般式(I)の定義において「ハロゲン原子」とは、塩素原子、臭素原子、フッ素原子又はヨウ素原子を示し、「n-」とはノルマルを、「s-」とはセカンダリーを、「t-」とはターシャリーを、「i-」とはイソを示し、「C₁-C₆アルキル」とは、例えばメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示し、「ハロ C₁-C₆アルキル」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロ

ゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「C₃-C₆シクロアルキル」とは、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の環状の炭素原子数3～6個のアルキル基を示す。

- 5 「複素環基」とは、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子から選択される1以上のヘテロ原子を有する5又は6員複素環基を示し、例えばピリジル基、ピリジーン-N-オキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロチオピラニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラゾリル基等を例示することができ、「縮合環」としては、例えばナフタレン、
- 10 テトラヒドロナフタレン、インデン、インダン、キノリン、キナゾリン、インドール、インドリン、クロマン、イソクロマン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ジヒドロベンゾチオフェン、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール、
- 15 インダゾール等を例示することができる。

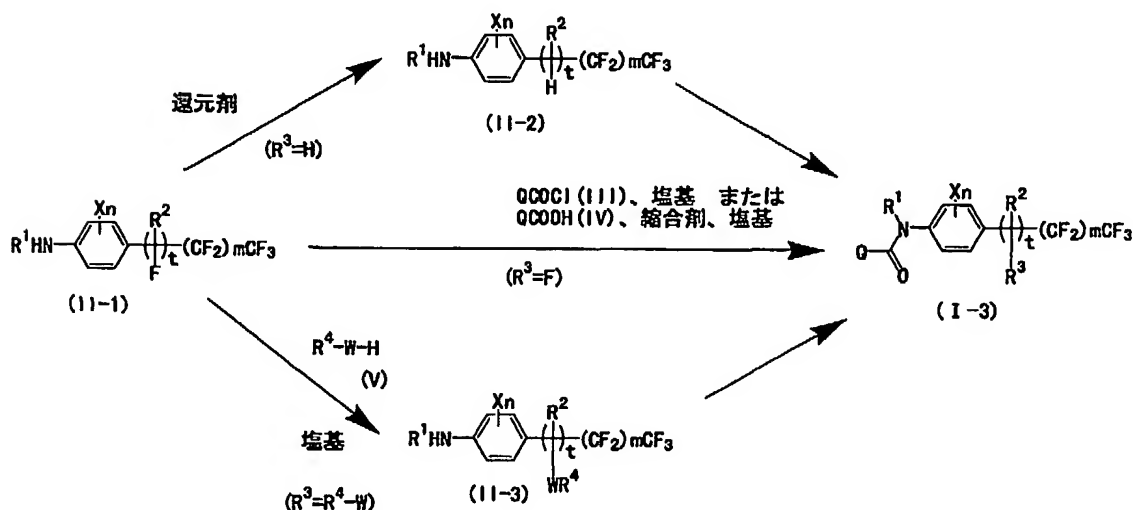
- 本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合
- 20 で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体は、その構造中式中に炭素-炭素二重結合に由来する2種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

- 本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体のうち、Qとして好ましくは、Q⁹、Q¹⁴、Q¹⁵であり、特に好ましくはQ⁹であり、Y¹として好ましくはハロゲン原子又はC₁-C₂アルキル基であり、特に好ましくは3, 5-
- 25 ジメチル基であり、Y³として好ましくはC₁-C₃アルキル基又はフェニル基であり、特に好ましくはメチル基であり、X_nとして好ましくは2位C₅-C₇アルキル基であり、特に好ましくは2位C₆アルキル基であり、Zとして特に好ましく

は酸素原子であり、 R^1 として特に好ましくは水素原子であり、 R^2 として特に好ましくはトリフルオロメチル基であり、 R^3 として好ましくは水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_2 アルコキシ基であり、特に好ましくは水素原子であり、 m として特に好ましくは0であり、 t として特に好ましくは1である。

- 5 以下に本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体の代表的な製造方法を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

製造方法1.



- (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 m 、 n 、 t 及び Q は前記に同じくし、 R^4 は
- 10 水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、フェニル基、置換フェニル基、フェニル C_1-C_4 アルキル基、 W は $-O-$ 、 $-S-$ 又は $-N(R^4)-$ (式中、 R^4 は前記に同じ。)を示す。)

- 一般式(I)で表される置換アニリド誘導体のうち、 Z が O で表される置換アニリド誘導体(I-3)は、一般式(II-1)～一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体と一般式(III)で表されるヘテロ環カルボン酸クロリドを塩基の存在下又は不存在下に、不活性溶媒中で反応させることにより、又は一般式(II-1)～一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体と一般式(IV)で表されるヘテロ環カルボン酸を縮合剤の存在下に、塩基の存在下又は不存在下、不活性溶媒中で反応させることにより製造することができるが、通常のアミド類の製造方法であれば
- 20 良い。

一般式(II-2)で表されるアニリン誘導体は、一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体を還元剤の存在下、不活性溶媒中で還元することにより製造することができる。

- 5 一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体は、一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体を塩基の存在下又は不存在下、不活性溶媒中で一般式(V)で表されるアルコール誘導体、チオール誘導体又はアミン誘導体と反応させることにより製造することができる。

一般式(II-1)→一般式(II-2).

- 10 本反応で使用できる還元剤としては、水素化リチウムアルミニウム、水素化ホウ素リチウム、水素化ホウ素ナトリウム、ジイソブチルアルミニウムヒドリド、水素化ビス(2-メトキシエトキシ)アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム等の金属水素化物、金属リチウム等の金属又は金属塩等を例示することができ、その使用量は一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体に対して当量乃至過剰量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。

- 15 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類等の不活性溶媒を
20 例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至50時間の範囲で行えば良い。

- 25 反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

一般式(II-1)→一般式(II-3).

本反応で利用できる塩基としては水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブトキシド等の金属アルコラート類、 n -ブチルリチウム、 s -ブチルリチウム、 t -ブチルリチウム等のアルキル金属類を例示することができ、その使用量は一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体に対して当量乃至過剰量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は -70°C 乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至50時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

一般式(II-1)、一般式(II-2)又は一般式(II-3) \rightarrow 一般式(I-3)。

本反応で使用する縮合剤としては、例えばシアノリン酸ジエチル(DEPC)、カルボニルジイミダゾール(CDI)、1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、クロロ炭酸エステル類、ヨウ化2-クロロ-1-メチルピリジニウム等を例示することができる。

本反応で使用する塩基としては、無機塩基又は有機塩基が挙げられ、無機塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属原子の水酸化物や水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属の水素化物、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブトキシド等のアルコールのアルカリ金属塩、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の炭酸塩類、有機塩基と

しては、例えばトリエチルアミン、ピリジン、DBU等を例示することができ、その使用量は一般式 (IV) で表されるヘテロ環カルボン酸誘導体に対して等モル乃至過剰モルの範囲から選択して使用すれば良い。

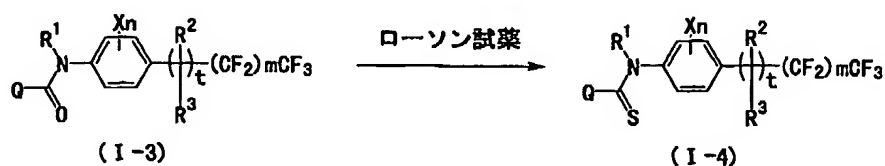
- 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及びアセトン、メチルエチルケトン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

- 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

- 本反応の原料化合物である一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体は、特開平11-302233号公報又は特開2001-122836号公報に開示の製造方法で製造することができる。

製造方法2.



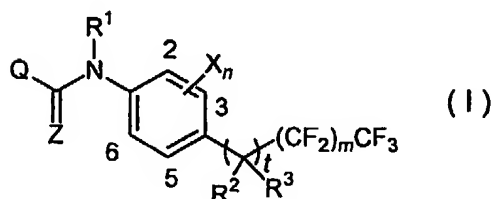
- (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 m 、 n 、 t 及び Q は前記に同じ。)

一般式 (I) で表される置換アニリド誘導体のうち、 Z が S で表される置換アニリド誘導体(I-4)は、(I-3)で表されるアニリン誘導体を公知の方法

(Tetrahedron Lett., 21 (42), 4061 (1980)) に準じてローソン試薬と反応させることにより製造することができる。

一般式(I) で表される置換アニリド誘導体の代表的な化合物を第1表乃至第4表に、また一般式(II) で表される置換アニリン誘導体の代表的な化合物を第6表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、第1表乃至第4表及び第6表中の物性は融点℃又は屈折率(℃)を示し、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Ph」はフェニル基を示す。

一般式 (I)



10

第1表 (Q=Q 9、R¹=H、R²=CF₃、Z=O、t=1)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-1	2-Me	3-CF ₃	Me	0	F	146-148
1-2	2-Et-6- <i>s</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	119
1-3	2- <i>n</i> -Pr	3-CF ₃	Me	0	F	152-153
1-4	2- <i>n</i> -Pr	3-Me-5-Cl	Me	0	H	85-87
1-5	2- <i>i</i> -Pr	3-CF ₃	Me	0	F	170-172
1-6	2- <i>i</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	
1-7	2- <i>i</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-8	2- <i>s</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	106
1-9	2- <i>s</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-10	2- <i>t</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	124-125
1-11	2- <i>t</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-12	2-(CH ₂) ₄ -3	3-CF ₃	Me	0	F	125-128
1-13	2-(CH ₂) ₄ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	F	
1-14	2-(CH ₂) ₄ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	H	165-166
1-15	2-(CH ₂) ₄ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-16	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	0	F	

第1表 (続き)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-17	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	O	H	130-131
1-18	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	O	OMe	
1-19	2-Ph	3-CF ₃	Me	O	F	139-140
1-20	2-Ph	3-Me-5-Cl	Me	O	H	145-147
1-21	2-CH(Me)CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	O	F	121
1-22	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3-Me-5-Cl	Me	O	H	82-83
1-23	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3-Me-5-Cl	Me	O	OMe	1.4983(19.1)
1-24	2-CH(Me)CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	O	F	
1-25	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3,5-Me ₂	Me	O	H	1.5051(20.1)
1-26	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3,5-Me ₂	Me	O	OMe	1.4921(20.2)
1-27	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	H	Me	O	H	
1-28	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	O	F	138-139
1-29	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Et	O	H	
1-30	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	O	H	146-147
1-31	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	O	OMe	
1-32	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	O	OE _t	
1-33	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	CHF ₂	O	H	1.4650(19.9)
1-34	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	O	H	1.4970(19.9)
1-35	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et	Me	O	H	35-38
1-36	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3- <i>i</i> -Pr	Me	O	H	45-47
1-37	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-F	Me	O	H	

第1表 (続き)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-38	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Me	O	H	1. 5111 (22. 2) アモルファス 129-130
1-39	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br	Me	O	H	
1-40	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-I	Me	O	H	
1-41	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-SMe	Me	O	H	
1-42	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-SOMe	Me	O	H	
1-43	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-SO ₂ Me	Me	O	H	102-105
1-44	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-OMe	Me	O	H	
1-45	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Me	Me	O	H	1. 4790 (25. 2)
1-46	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-SMe	Me	O	H	1. 6201 (16. 8)
1-47	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-SOMe	Me	O	H	1. 4930 (23. 7)
1-48	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-SO ₂ Me	Me	O	H	48
1-49	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-F	Me	O	H	1. 5110 (21. 7)
1-50	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Cl	Me	O	H	
1-51	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Cl	Et	O	H	
1-52	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Cl	CH ₂ CH ₂ F	O	H	1. 4931 (22. 5)
1-53	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Br	Me	O	H	1. 5061
1-54	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Br	Et	O	H	
1-55	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Br	<i>t</i> -Bu	O	H	67-68
1-56	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-I	Me	O	H	119-120
1-57	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-I	Et	O	H	132-133
1-58	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-I	<i>t</i> -Bu	O	H	98-99
1-59	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-I	Ph	O	H	127-128
1-60	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl-5-Me	Me	O	H	95-97

第1表 (続き)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-61	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br-5-Me	Me	0	° H	1.5208(21.1)
1-62	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-I-5-Me	Me	0	H	1.5252(21.1)
1-63	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-I-5-Me	Et	0	H	170-171
1-64	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	0	F	
1-65	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	0	H	1.4974(22.8)
1-66	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	0	OMe	
1-67	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	1	F	
1-68	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	1	H	
1-69	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	1	OMe	
1-70	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	F	88-90
1-71	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	H	1.5025(23.7)
1-72	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	アモルファス
1-73	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	OEt	1.5003(15.7)
1-74	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	F	
1-75	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	H	
1-76	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	OMe	
1-77	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	OEt	
1-78	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Et	0	H	1.4905(21.2)
1-79	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Et	0	OMe	
1-80	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Et	0	OEt	
1-81	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Me	0	H	134-135
1-82	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Me	0	OMe	96-97
1-83	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Et	0	OH	1.5140(22.2)

第1表 (続き)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-84	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Et	0	H	153-155
1-85	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et-5-Br	Me	0	H	110-112
1-86	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et-5-Br	Me	0	OMe	アモルファス
1-87	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-I	Me	0	H	184-185
1-88	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-I	Me	0	OMe	
1-89	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-I	Et	0	H	174
1-90	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SMe	Me	0	H	1.5140(22.2)
1-91	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SMe	Me	0	OMe	
1-92	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SOMe	Me	0	H	42-43
1-93	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SOMe	Me	0	OMe	
1-94	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SO ₂ Me	Me	0	H	1.4993(22.1)
1-95	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SO ₂ Me	Me	0	OMe	
1-96	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OMe	Me	0	H	1.5020(20.9)
1-97	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OMe	Me	0	OMe	
1-98	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OPh	Me	0	H	1.5182(20.5)
1-99	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OPh	Me	0	OMe	
1-100	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-OMe-5-Br	Me	0	H	143-144
1-101	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-OMe-5-SP _r - <i>n</i>	Me	0	H	102
1-102	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-Cl	Et	0	H	
1-103	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-Cl	Me	0	H	102-104

第1表 (続き)

No.	X <i>n</i>	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-104	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-Cl	Me	O	OMe	1.4712(18.2)
1-105	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-OPh	Me	O	H	1.4951(19.4)
1-106	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	O	F	81-82
1-107	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	O	H	1.4958(15.7)
1-108	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	O	OMe	94-96
1-109	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	O	OEt	1.4958(20.1)
1-110	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	l	F	
1-111	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	l	H	
1-112	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	l	OMe	
1-113	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	l	OEt	
1-114	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Et	O	F	1.4950(18.4)
1-115	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Et	O	H	
1-116	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Et	O	OMe	
1-117	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Et	O	OEt	
1-118	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	<i>n</i> -Pr	O	F	1.4907(19.2)
1-119	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	<i>n</i> -Pr	O	H	1.4970(17.4)
1-120	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	<i>n</i> -Pr	O	OMe	
1-121	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	<i>n</i> -Pr	O	OEt	
1-122	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Ph	O	F	
1-123	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Ph	O	H	
1-124	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Ph	O	OMe	
1-125	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Ph	O	OEt	
1-126	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-F ₂	Me	O	F	

第1表 (続き)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-127	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-F ₂	Me	O	H	73
1-128	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-F ₂	Me	O	OMe	
1-129	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Cl ₂	Me	O	H	
1-130	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Cl ₂	Me	O	OMe	
1-131	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Cl ₂	Et	O	H	129-130
1-132	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et-5-Cl	Me	O	H	アモルファス
1-133	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3- <i>n</i> -Pr-5-Cl	Me	O	H	1.4890 (21.5)
1-134	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3- <i>i</i> -Pr-5-Cl	Me	O	H	1.4822 (20.3)
1-135	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3- <i>t</i> -Bu-5-Cl	Me	O	H	1.4881 (20.3)
1-136	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	O	F	
1-137	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	O	H	
1-138	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	O	OMe	
1-139	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	1	F	
1-140	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	1	H	
1-141	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	1	OMe	
1-142	2-CH(Me)(CH ₂) ₃ Me	3-Me-5-Cl	Me	O	F	1.4931 (19.5)
1-143	2-CH(Me)(CH ₂) ₃ Me	3-Me-5-Cl	Me	O	H	1.5020 (19.5)
1-144	2-CH(Me)(CH ₂) ₃ Me	3-Me-5-Cl	Me	O	OMe	1.5003 (19.6)
1-145	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	O	F	1.4907 (20.3)
1-146	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	O	H	1.4905 (20.4)
1-147	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	O	OMe	

第1表 (続き)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-148	2-CH(Me) (CH ₂) ₂ CH Me ₂	3, 5-Me ₂	Me	O	F	アモルファス
1-149	2-CH(Me) (CH ₂) ₂ CH Me ₂	3, 5-Me ₂	Me	O	H	
1-150	2-CH(Me) (CH ₂) ₂ CH Me ₂	3, 5-Me ₂	Me	O	OMe	
1-151	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂ -3-Me	3, 5-Me ₂	Me	O	F	1. 4904 (25. 5)
1-152	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂ -3-Me	3, 5-Me ₂	Me	O	H	1. 4863 (25. 5)
1-153	2-CH(Me) CH ₂ CH(Me) CH ₂ CH ₃	3-Me-5-Cl	Me	O	OMe	
1-154	2-C(Me)=CHCHMe ₂ -3-Me	3, 5-Me ₂	Me	O	F	1. 4950 (25. 5)
1-155	2-C(Me)=CHCHMe ₂ -3-Me	3, 5-Me ₂	Me	O	H	1. 5052 (25. 2)
1-156	2-CH(Me) CH ₂ CH(Me) CH ₂ CH ₃	3, 5-Me ₂	Me	O	OMe	
1-157	2-CH(Me) Ph	3, 5-Me ₂	Me	O	F	
1-158	2-CH(Me) Ph	3, 5-Me ₂	Me	O	H	
1-159	2-CH(Me) Ph	3, 5-Me ₂	Me	O	OMe	
1-160	2-CH(Me) CH ₂ CMe ₃	3, 5-Me ₂	Me	O	F	
1-161	2-CH(Me) CH ₂ CMe ₃	3, 5-Me ₂	Me	O	H	
1-162	2-CH(Me) CH ₂ CMe ₃	3, 5-Me ₂	Me	O	OMe	
1-163	2, 3-Me ₂	3, 5-Me ₂	Me	O	F	132-136
1-164	2, 3-Me ₂	3, 5-Me ₂	Me	O	H	167-170

第2表 (Q=Q 9、R¹=H、Z=O、t=1)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ²	R ³	物性
2-1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	0	F	F	
2-2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	0	H	H	
2-3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	2	F	F	
2-4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	2	H	H	
2-5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	4	F	F	
2-6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	4	H	H	
2-7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	6	F	F	
2-8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	Me	6	H	H	
2-9	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	F	F	
2-10	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	H	H	
2-11	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	2	F	F	
2-12	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	2	H	H	
2-13	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	4	F	F	
2-14	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	4	H	H	
2-15	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	6	F	F	
2-16	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	6	H	H	

第3表 ($R^1 = H$ 、 $R^2 = CF_3$ 、 $Z = O$ 、 $m = 0$ 、 $t = 1$)

No	Q	X _n	Y ¹ _{p, q, r} 又は Y ²	R ³	物性
3-1	Q 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	H	108-109 1.4860 (22.7)
3-2	Q 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Cl ₂	H	
3-3	Q 2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-CF ₃	H	
3-4	Q 2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Cl	H	
3-5	Q 2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Cl-6-Me	H	アモルファス
3-6	Q 3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	H	
3-7	Q 3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,6-Cl ₂	H	
3-8	Q 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-SMe-4-CF ₃	H	
3-9	Q 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-CF ₃	H	104 アモルファス
3-10	Q 1 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	Me	F	
3-11	Q 1 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	Me	H	
3-12	Q 1 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	CF ₃	H	
3-13	Q 1 2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	H	72-73
3-14	Q 1 2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2,4-Me ₂	OMe	
3-15	Q 1 3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br	F	

第3表 (続き)

No	Q	X _n	Y ¹ _{p, q, r} 又はY ²	R ³	物性
3-16	Q 1 3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br	H	1. 5080 (20. 4)
3-17	Q 1 3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br	OMe	
3-18	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Br	H	
3-19	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Br	OMe	
3-20	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Br	OEt	
3-21	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Br	H	
3-22	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Br	OMe	
3-23	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Br	OEt	
3-24	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	H	
3-25	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	OMe	
3-26	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	OEt	
3-27	Q 1 5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	H	H	133. 5-135
3-28	Q 1 5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	H	
3-29	Q 1 5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br	H	
3-30	Q 1 5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-I	H	

第3表 (続き)

No	Q	X _n	Y ¹ _{p, q, r} 又はY ²	R ³	物性
3-31	Q 1 5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-I	OMe	1.5081 (18.5)
3-32	Q 1 8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Cl	H	104.5-106
3-33	Q 1 8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Me-5-(2-Cl-Ph)	H	1.5425 (21.1)
3-34	Q 2 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	H	アモルファス
3-35	Q 2 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	OMe	1.4870 (19.4)
3-36	Q 2 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	H	
3-37	Q 2 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3,5-Me ₂	OMe	

第4表 (R¹=H、R²=CF₃、Z=O、m=0、t=1)

No	Q	X _n	Y ¹ _p 又は _r	Y ³	R ³	物性
4-1	Q 8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Cl-5-Me	Me	H	160
4-2	Q 8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Br-5-Me	Me	H	149-150
4-3	Q 1 0	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	H	1.4848(23.6)

第4表 (続き)

No	Q	X _n	Y ¹ _p 又は _r	Y ³	R ³	物性
4-4	Q 1 0	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-4-Cl	Me	H	108-109
4-5	Q 1 0	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-4-Br	Me	H	112-113
4-6	Q 1 0	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3- <i>t</i> -Bu-4-Cl	Me	H	1. 4915 (23. 9)
4-7	Q 1 0	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-4-NO ₂	Me	H	1. 4971 (25. 3)
4-8	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Me	F	1. 5062 (18. 4)
4-9	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Me	H	
4-10	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Me	OMe	
4-11	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Me	OE _t	
4-12	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Et	F	
4-13	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Et	H	
4-14	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Et	OMe	

第4表 (続き)

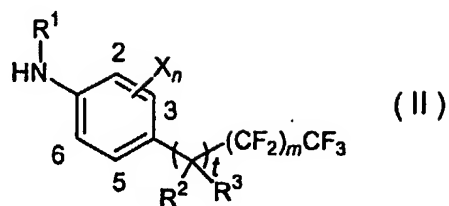
No	Q	X _n	Y ¹ _p 又は _r	Y ³	R ³	物性
4-15	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Et	OE _t	
4-16	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	F	
4-17	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	H	
4-18	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	OMe	
4-19	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	OE _t	
4-20	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	F	
4-21	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	H	
4-22	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	OMe	
4-23	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	OE _t	

- 5 第1から表4中、物性がアモルファスで示される化合物の¹H-NMRデータを第5表に示す。

第5表

No.	$^1\text{H-NMR}[\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta \text{ 値 (ppm)}]$
1-40	8.20 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.32-7.25 (m, 2H), 4.05 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.20 (m, 1H), 1.65-1.40 (m, 3H), 1.24 (d, 3H), 0.84 (m, 6H)
1-72	8.04 (d, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.46-7.39 (m, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 3.03 (m, 3H), 2.52 (s, 3H), 1.69-1.40 (m, 3H), 1.23 (d, 3H), 0.84 (d, 6H)
1-86	8.01 (d, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.47-7.39 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 3.07 (m, 1H), 2.94 (m, 1H), 1.67-1.40 (m, 3H), 1.30-1.20 (m, 6H), 0.84 (d, 6H)
1-132	7.98 (d, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.30-7.21 (m, 2H), 4.04 (m, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.10-2.80 (m, 3H), 1.63-1.40 (m, 3H), 1.33-1.18 (m, 6H), 0.84 (d, 6H)
1-148	8.13 (d, 1H), 7.50-7.40 (m, 2H), 7.33 (s, 1H), 3.77 (s, 3H), 2.82 (m, 1H), 2.54 (s, 3H), 2.51 (s, 3H), 1.72-1.52 (m, 2H), 1.52-1.39 (m, 1H), 1.27 (d, 3H), 1.21-1.10 (m, 1H), 1.10-0.91 (m, 1H), 0.82 (d, 6H)
3-5	8.32 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.35-7.20 (m, 3H), 4.06 (m, 1H), 3.05 (m, 1H), 2.61 (s, 3H), 1.60-1.40 (m, 3H), 1.22 (d, 3H), 0.84 (d, 6H)
3-34	7.85 (d, 1H), 7.31-7.20 (m, 3H), 4.06 (m, 1H), 2.92 (m, 1H), 2.67 (s, 3H), 2.51 (s, 3H), 1.60-1.40 (m, 3H), 1.22 (t, 3H), 0.85 (m, 6H)

一般式 (II)

第6表 ($R^1=H$, $t=1$)

No	X _n	m	R ²	R ³	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ 値(ppm)]
5-1	2- <i>n</i> -Pr	0	CF ₃	H	7.12-7.02 (m, 2H), 6.69 (d, 1H), 4.0-3.7 (m, 3H), 2.52 (q, 2H), 1.27 (t, 3H)
5-2	2- <i>t</i> -Bu	0	CF ₃	H	7.17 (s, 1H), 7.06 (d, 1H), 6.64 (d, 1H), 4.1-3.9 (br, 2H), 3.91 (m, 1H), 1.41 (s, 9H)
5-3	2-Ph	0	CF ₃	H	7.52-7.32 (m, 5H), 7.19-7.10 (m, 2H), 6.77 (d, 1H), 4.08-3.85 (m, 3H)
5-4	2-CH(Me) CHMe ₂	0	CF ₃	H	7.08-7.01 (m, 2H), 6.71 (s, 1H), 3.91 (m, 1H), 2.50 (m, 1H), 1.87 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.92 (d, 3H), 0.87 (d, 3H)
5-5	2-CH(Me) CHMe ₂ -6-Et	0	CF ₃	H	6.96 (d, 2H), 3.92 (m, 1H), 3.85-3.70 (br, 2H), 2.65 (m, 1H), 2.53 (dd, 2H), 1.80-1.50 (m, 2H), 1.23 (d, 3H), 0.90 (t, 3H)
5-6	2-(CH ₂) ₄ -3	0	CF ₃	H	7.24 (d, 1H), 6.60 (d, 1H), 4.41 (m, 1H), 3.76 (br, 2H), 2.70 (br, 2H), 2.47 (br, 2H), 1.84 (m, 4H)

第6表 (続き)

No	X _n	m	R ²	R ³	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, δ 値 (ppm)]
5-7	2-CH=CH-CH =CH-3	O	CF ₃	H	7.91-7.84 (m, 2H), 7.68-7.47 (m, 3H), 6.82 (d, 1H), 4.96 (m, 1H), 4.40-4.20 (br, 2H)
5-8	2-CH(Me) CH ₂ CH ₃	O	CF ₃	H	7.06-6.98 (m, 2H), 6.67 (d, 1H), 3.91 (m, 1H), 3.85-3.70 (br, 2H), 2.62 (m, 1H), 1.78-1.50 (m, 2H), 1.22 (d, 3H), 0.89 (t, 3H)
5-9	2-CH(Me) CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CF ₃	H	7.08-7.00 (m, 2H), 6.67 (d, 1H), 3.91 (m, 1H), 3.82-3.70 (br, 2H), 2.71 (m, 1H), 1.70-1.50 (m, 2H), 1.40-1.20 (m, 5H), 0.90 (t, 3H)
5-10	2-CH(Me) CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CF ₃	OMe	7.24 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.00-3.82 (br, 2H), 3.43 (s, 3H), 2.73 (m, 1H), 1.70-1.45 (m, 2H), 1.40-1.20 (m, 5H), 0.90 (t, 3H)
5-11	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	O	CF ₃	H	7.10-7.00 (m, 2H), 6.69 (s, 1H), 3.91 (m, 1H), 2.80 (m, 1H), 1.65-1.50 (m, 2H), 1.43-1.32 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.89 (t, 6H)
5-12	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	O	CF ₃	OH	7.39 (s, 1H), 7.30 (d, 1H), 6.68 (d, 1H), 3.90-3.60 (br, 2H), 2.79 (m, 1H), 1.61-1.50 (m, 1H), 1.45-1.35 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.89 (q, 6H)
5-13	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	O	CF ₃	OMe	7.26 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.00-3.65 (br, 2H), 3.43 (s, 1H), 2.79 (m, 1H), 1.56 (m, 2H), 1.37 (m, 1H), 1.20 (d, 3H), 0.91 (t, 6H)
5-14	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	O	CF ₃	OEt	7.26 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.69 (d, 1H), 3.98-3.67 (br, 2H), 3.59 (q, 2H), 2.80 (m, 1H), 1.56 (m, 2H), 1.38 (m, 1H), 1.30 (t, 3H), 1.20 (d, 3H), 0.89 (t, 6H)

第6表 (続き)

No	X _n	m	R ²	R ³	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ 値(ppm)]
5-15	2-CH(Me) CH ₂ CH ₂ CH Me ₂	0	CF ₃	H	7.08-7.00(m, 2H), 6.68(d, 1H), 3.92(m, 1H), 3.99-3.70(br, 2H), 2.65(m, 1H), 1.78-1.42 (m, 4H), 1.30-1.10(m, 5H), 0.86(d, 6H)
5-16	2-CH(Me) CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	CF ₃	H	7.26(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.71(d, 1H), 3.95-3.78(br, 2H), 2.69(m, 1H), 1.72-1.42 (m, 2H), 1.40-1.18(m, 7H), 0.88(t, 3H)
5-17	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	0	H	H	6.98(s, 1H), 6.92(d, 1H), 6.65(d, 1H), 3.85-3.60(br, 2H), 3.24(dd, 2H), 2.79(m, 1H), 1.65-1.48(m, 2H), 1.45-1.30(m, 1H), 1.19(d, 3H), 0.90(t, 6H)
5-18	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	2	H	H	6.97(s, 1H), 6.90(d, 1H), 6.65(d, 1H), 3.82-3.40(br, 2H), 3.23(t, 2H), 2.79(m, 1H), 1.70-1.50(m, 2H), 1.39(m, 1H), 1.20(d, 3H), 0.90(t, 6H)
5-19	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	4	H	H	6.97(s, 1H), 6.92(d, 1H), 6.65(d, 1H), 4.00-3.70(br, 2H), 3.24(t, 2H), 2.79(m, 1H), 1.68-1.48(m, 2H), 1.45-1.30 (m, 1H), 1.22(d, 3H), 0.89(m, 6H)
5-20	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	6	H	H	6.97(s, 1H), 6.90(d, 1H), 6.65(d, 1H), 3.24(t, 2H), 2.79(m, 1H), 1.67-1.45(m, 2H), 1.42-1.30(m, 1H), 1.22(d, 3H), 0.90(t, 6H)

以下に本発明の代表的な実施例、製剤例及び試験例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

- 5 実施例 1-1. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン (化合物 No. 5-11) の製造

水素化リチウムアルミニウム (2 g, 52.7 mmol) をテトラヒドロフラン (60 ml) に懸濁させ、2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-[1, 2, 2,

- 10 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン (14 g,

40. 5 mmol) を滴下し、還流温度で3時間攪拌した。氷冷下、反応液に水を少量ずつ加え、その後10分間攪拌した。硫酸マグネシウムを加え、その後10分間攪拌した。反応液をセライトろ過し、ろ液を減圧濃縮することにより、目的物13gを得た。

5 収率98%

実施例1-2. N- {2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [2, 2, 2-トリフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル} -5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-4-カルボン酸アミド (化合物No. 1-103) の製造

- 10 5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-4-カルボン酸 (230mg, 1mmol) をチオニルクロリド (2ml) に溶解し、還流温度で2時間攪拌した。減圧濃縮後、得られた酸クロリドを2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [2, 2, 2-トリフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] アニリン (330mg, 1mmol) 及びトリエチルアミン (150mg, 1.5mmol) をテトラヒドロフラン (10ml) に溶解した溶液に氷冷下に加え、室温で2時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=3:1) にて分離精製することにより目的物233mgを得た。

- 20 物性: 融点102-104℃ 収率43%

実施例2-1. 2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [1-メトキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] アニリン (化合物No. 5-13) の製造

- 25 ナトリウム (533mg, 23mmol) をメタノール (40ml) に溶解した後、2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] アニリン (2g, 5.8mmol) を加え、還流温度で3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、残渣を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=

6 : 1) にて分離精製することにより目的物 1. 8 g を得た。

収率 87 %

実施例 2-2. N- {2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [1-メトキシ
-2, 2, 2-トリフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル}
5 -1, 3, 5-トリメチルピラゾール-4-カルボン酸アミド (化合物 No. 1
-108) の製造

1, 3, 5-トリメチルピラゾール-4-カルボン酸 (154 mg,
1 mmol) をチオニルクロリド (5 ml) に溶解し、2 時間加熱還流した。反
応液を減圧濃縮後、得られた酸クロリドを氷冷下、2- (1, 3-ジメチルブチ
10 ル) -4- [1-メトキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1- (トリフルオロメ
チル) エチル] アニリン (345 mg, 1 mmol) 及びトリエチルアミン (1
50 mg, 1.5 mmol) をテトラヒドロフラン (10 ml) に溶解した溶液
に加え、その後 2 時間加熱還流した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水洗した。
有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲ
15 ルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 2) にて分離精製す
ることにより目的物 200 mg を得た。

物性 : 融点 94-96 °C 収率 41 %

実施例 3-1. 2- (1-ヒドロキシ-1, 4-ジメチルペンチル) アニリン
の製造

20 ジエチルエーテル (15 ml) にマグネシウム (960 mg, 40 mmol) を加
え、触媒量のヨウ素を加えた後、イソアミルブロミド (6.04 g,
40 mmol) を還流下徐々に加え、還流温度で 30 分間攪拌後、室温で 30 分
間攪拌した。この溶液に、氷冷下に 2-アミノアセトフェノン (1.8 g, 13.
3 mmol) を加え、室温で 3 時間攪拌した。塩化アンモニウムを加えた後、酢
25 酸エチルで希釈し、水洗した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、
2- (1-ヒドロキシ-1, 4-ジメチルペンチル) アニリン 2.7 g を得た。

物性 $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 値 (ppm)]

7.10-7.00 (m, 2H), 6.72-6.60 (m, 2H), 4.00-3.70 (br, 2H), 2.03 (m, 2H),

1.61 (s, 3H), 1.50 (m, 2H), 1.20-1.00 (m, 1H), 0.90-0.83 (m, 6H)

収率 99%

実施例 3-2. 2-(1,4-ジメチルペンチル)アニリンの製造

実施例 3-1 で得られた 2-(1-ヒドロキシ-1,4-ジメチルペンチル)アニリン 2.7 g (13.1 mmol) をトルエンに希釈し、パラトルエンスルホン酸一水和物 (225 mg) を加え、ディーンスターク管で還流下 3 時間かけて脱水した。反応液を酢酸エチルで希釈後、重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣を、エタノールに溶解し、5%パラジウムカーボン (100 mg) を加え、水素雰囲気下室温で 12 時間攪拌した。反応液をセライトろ過し、残渣を減圧濃縮し、2-(1,4-ジメチルペンチル)アニリン 2.2 g を得た。

物性: $^1\text{H-NMR}[\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta \text{ 値 (ppm)}]$

7.10 (dd, 2H), 7.02 (dt, 1H), 6.79 (dt, 1H), 6.69 (dd, 1H), 3.67 (bs, 2H), 2.68 (m, 1H), 1.80-1.42 (m, 4H), 1.30-1.10 (m, 5H), 0.87 (d, 6H)

収率 87%

15 実施例 3-3. 2-(1,4-ジメチルペンチル)-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリンの製造

実施例 3-2 で得られた 2-(1,4-ジメチルペンチル)アニリン (1.8 g, 9.4 mmol) を *t*-ブチルメチルエーテル-水の 1:1 の溶液 (50 ml) に溶解し、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチルヨード (2.78 g, 9.4 mmol)、テトラ-*n*-ブチルアンモニウム硫酸水素塩 (318 mg, 0.94 mmol)、炭酸水素ナトリウム (795 mg, 9.4 mmol)、亜ジチオン酸ナトリウム (1.63 g, 9.4 mmol) を順次加え、室温で 12 時間攪拌した。反応液をヘキサンで希釈し、3N-塩酸で 2 度洗浄後、重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を硫酸
25 マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、目的物 3.28 g を得た。

物性: $^1\text{H-NMR}[\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta \text{ 値 (ppm)}]$

7.26 (s, 1H), 7.21 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 4.05-3.80 (br, 2H), 2.67 (m, 1H), 1.78-1.40 (m, 4H), 1.30-1.00 (m, 5H), 0.85 (d, 6H)

収率 97%

実施例 3-4. 2-(1, 4-ジメチルペンチル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン (化合物 No. 5-15) の製造

2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリンのかわりに2-(1, 4-ジメチルペンチル)-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリンを用いた以外は実施例 1-1 と同様にして、4 時間反応を行うことにより目的物を得た。

収率 82%

10 実施例 3-5. N-{2-(1, 4-ジメチルペンチル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-5-クロロ-1, 3-ジメチルピラゾール-4-カルボン酸アミド (化合物 No. 1-146) の製造

5-クロロ-1, 3-ジメチルピラゾール-4-カルボン酸 (349 mg, 2 mmol) をチオニルクロリド (10 ml) に溶解し、還流温度で 2 時間攪拌した。減圧濃縮後、得られた酸クロリドを 2-(1, 4-ジメチルペンチル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン (682 mg, 2 mmol) 及びトリエチルアミン (300 mg, 3 mmol) をテトラヒドロフラン (20 ml) に溶解した溶液に氷冷下に加え、還流温度で 20 2 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 3) にて分離精製することにより目的物 200 mg を得た。

物性: 屈折率 1.4905 (20.4°C) 収率 41%

25 実施例 4-1. 4-ヨード-2-(1, 3-ジメチルブチル)アニリンの製造

ヨウ素 2.53 g (10 mmol) をメタノールに溶解し、2-(1, 3-ジメチルブチル)アニリンを (1.77 g, 10 mmol) を氷冷下加えたのち、炭酸水素ナトリウム (1.26 g, 15 mmol) の水溶液を加え 0°C で 4 時間攪拌した。反応液にチオ硫酸ナトリウムを加えた後、減圧濃縮し、酢酸エチルで

希釈後、水洗した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１０：１）にて分離精製し、目的物 2.71 g を得た。

収率 89 %

5 実施例 4-2. 2-（１，３-ジメチルブチル）-4-ペンタフルオロエチル-アニリンの製造

4-ヨード-2-（１，３-ジメチルブチル）アニリン（1.35 g, 4.45 mmol）、銅粉（0.85 g, 13.4 mmol）、ペンタフルオロエチルヨージド（1.42 g, 5.77 mmol）をジメチルスルホキシド

- 10 （10 ml）に加え、130℃で4時間攪拌した。セライトろ過後、ろ液を酢酸エチルで希釈し、4回水洗した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し目的物 1.24 g を得た。

物性：¹H-NMR[CDCl₃/TMS, δ 値(ppm)]

7.26(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.70(d, 1H), 4.00-3.85(br, 2H), 3.00(m, 1H),

- 15 1.68-1.50(m, 2H), 1.48-1.30(m, 1H), 1.22(t, 3H), 0.94(m, 6H)

収率 95 %

実施例 4-3. 2-（１，３-ジメチルブチル）4-（２，２，２-トリフルオロエチル）アニリン（化合物 No. 5-17）の製造

- 20 水素化リチウムアルミニウム（1.62 g, 4.26 mmol）をテトラヒドロフラン（20 ml）に溶解し、2-（１，３-ジメチルブチル）-4-ペンタフルオロエチルアニリン（974 mg, 3.3 mmol）を滴下し、還流温度で3時間攪拌した。氷冷下、反応液に水を少量ずつ加え、その後10分間攪拌した。硫酸マグネシウムを加え、その後10分間攪拌した。反応液をセライトろ過し、ろ液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝9：1）にて分離精製し目的物 260 mg を得た。

収率 30 %

実施例 5-1. 2-（１，３-ジメチルブチル）-4-ノナフルオロブチルアニリンの製造

ペンタフルオロエチルヨージドのかわりにノナフルオロブチルヨージドを用い

た以外は実施例 4-2 と同様にして 4 時間反応を行うことにより目的物を得た。

物性： $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 値 (ppm)]

7.25 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.71 (d, 1H), 4.02-3.85 (m, 2H), 2.79 (m, 1H),

1.68-1.50 (m, 2H), 1.50-1.35 (m, 1H), 1.22 (d, 3H), 0.90 (t, 6H)

5 収率 90%

実施例 5-2. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-(2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘptaフルオロヘキシル) アニリン (化合物 No. 5-18) の製造

2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ペンタフルオロエチルアニリンのかわりに 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ノナフルオロブチルアニリンを用い

10 た以外は実施例 4-3 と同様にして 3 時間攪拌することにより目的物を得た。

収率 92%

実施例 6-1. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-トリデカフルオロヘキシルアニリンの製造

ペンタフルオロエチルヨージドのかわりにトリデカフルオロヘキシルヨージド
15 を用いた以外は実施例 4-2 と同様にして 4 時間反応を行うことにより目的物を得た。

物性： $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 値 (ppm)]

7.25 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.71 (d, 1H), 4.05-3.87 (m, 2H), 2.79 (m, 1H),

1.68-1.50 (m, 2H), 1.48-1.30 (m, 1H), 1.22 (d, 3H), 0.90 (t, 6H)

20 収率 87%

実施例 6-2. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-(2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-ウンデカフルオロヘキシル) アニリン (化合物 No. 5-19) の製造

2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ペンタフルオロエチルアニリンのかわ
25 りに 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-トリデカフルオロヘキシルアニリンを用いた以外は実施例 4-3 と同様にして 3 時間攪拌することにより目的物を得た。

収率 85%

実施例 7-1. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ヘptaデカフルオロオク

チルアニリンの製造

ペンタフルオロエチルヨードのかわりにヘプタデカフルオロオクチルヨードを用いた以外は実施例 4-2 と同様にして 4 時間反応を行うことにより目的物を得た。

5 物性： $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 値 (ppm)]

7.24 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.05-3.85 (br, 2H), 2.78 (m, 1H),

1.67-1.50 (m, 3H), 1.50-1.32 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.89 (t, 6H)

収率 40%

実施例 7-2. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-(2, 2, 3, 3, 4,
10 4, 5, 5, 6, 6, 6-ペンタデカフルオロオクチル) アニリン (化合物 No. 5-20) の製造

2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ペンタフルオロエチルアニリンのかわりに 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ヘプタデカフルオロオクチルアニリンを用いた以外は実施例 4-3 と同様にして 3 時間攪拌することにより目的物を
15 得た。

収率 58%

本発明の一般式 (I) で表される置換アニリド誘導体を有効成分として含有する農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤、又は殺ダニ剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉用を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫
20 等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.)、リンゴコシンクイ (*Grapholita inopinata*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、クワハマキ (*Olethreutes mori*)、チャノホソガ (*Caloptilia thevivor*)、リンゴホソガ (*Caloptilia zachrysa*)、キンモ
25 ンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*)、ナシホソガ (*Spulerrina astaurota*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、オオタバコガ類 (*Heliothis* sp.)、コドリガ (*Laspeyresia pomonella*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、リンゴヒメシンクイ (*Argyresthia conjugella*)、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis*

- medinalis)、チャマダラメイガ(*Ephestia elutella*)、クワノメイガ(*Glyphodes pyloalis*)、サンカメイガ(*Scirpophaga incertulas*)、イチモンジセセリ(*Parnara guttata*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、イネヨトウ(*Sesamia inferens*)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ
- 5 (*Spodoptera egigua*)等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ(*Macrosteles fascifrons*)、ツマグロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)、ミカンキジラミ(*Diaphorina citri*)、ブドウコナジラミ(*Aleurolobus taonabae*)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)、ニ
- 10 セダイコンアブラムシ(*Lipaphis erysimi*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、ツノロウムシ(*Ceroplastes ceriferus*)、ミカンワタカイガラムシ(*Pulvinaria aurantii*)、ミカンマルカイガラムシ(*Pseudaonidia duplex*)、ナシマルカイガラムシ(*Comstockaspis perniciosus*)、ヤノネカイガラムシ(*Unaspis yanonensis*)等の半翅目害虫、ネグサレセンチュウ(*Pratylenchus* sp.)、ヒメコ
- 15 ガネ(*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ(*Popilla japonica*)、タバコシバンムシ(*Lasioderma serricorne*)、ヒラタキクイムシ(*Lyctus brunneus*)、ニジュウヤホシテントウ(*Epilachna vigintiotopunctata*)、アズキノウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、ヤサイゾウムシ(*Listroderes costirostris*)、コクゾウムシ(*Sitophilus zeamais*)、ワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis*)
- 20 *grandis*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、マツノキクイムシ(*Tomicus piniperda*)、コロラドポテトビートル(*Leptinotarsa decemlineata*)、メキシカンピーンビートル(*Epilachna varivestis*)、コーンルートワーム類(*Diabrotica* sp.)等の甲虫目害
- 25 虫、ウリミバエ(*Dacus*(*Zeugodacus*)*cucurbitae*)、ミカンコミバエ(*Dacus*(*Bactrocera*)*dorsalis*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、タマネギバエ(*Delia antiqua*)、タネバエ(*Dalia platura*)、ダイズサヤタマバエ(*Asphondylia* sp.)、イエバエ(*Musca domestica*)、アカイエカ(*Culex pipiens pipiens*)等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus coffeae*)、

- ジャガイモシストセンチュウ (*Glabodera rostchiensis*)、ネコブセンチュウ (*Meloidogyne* sp.)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネグサレセンチュウ (*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabosi*)等のハリセンチュウ目害虫、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、
- 5 リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai* Kishida)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae* Koch)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theae*)、ミカンサビハダニ (*Aculops pelekassi*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)等のダニ目害虫に対して強い殺虫効果を有するものである。
- 10 又、本発明の一般式(I) で表される置換アニリド誘導体を有効成分とする農園芸用薬剤は農園芸用殺菌剤としても有用であり、例えば稲いもち病 (*Pyricularia oryzae*)、稲紋枯病 (*Rhizoctonia solani*)、稲胡麻葉枯病 (*Cochiobolus miyabeanus*)、大麦及び小麦のうどんこ病 (*Erysiphe graminis*) の如き種々の宿主植物についてのうどんこ病、エンバクの冠さび病 (*Puccinia coronata*) 及び他
- 15 の植物のさび病、トマトの疫病 (*Phytophthora infestans*) 及び他の植物の疫病、キュウリのべと病 (*Pseudoperonospora cubensis*)、ブドウのべと病 (*Plasmopara viticola*) 等の種々植物のべと病、リンゴ黒星病 (*Venturia inaequalis*)、リンゴ斑点落葉病 (*Alternaria mali*)、ナシ黒斑病 (*Alternaria kikuchiana*)、カンキツ黒点病 (*Diaporthe citr*)、シュードモナス種、例えばキュウリ斑点細菌病
- 20 (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)、トマト青枯病 (*Pseudomonas solanacearum*)、キサントモナス種、例えばキャベツ黒腐病 (*Xanthomonas campestris*)、稲白葉枯病 (*Xanthomonas oryzae*)、カンキツかいよう病 (*Xanthomonas citri*)、エルウィニア種、例えばキャベツ軟腐病 (*Erwinia carotovora*)等の細菌病、タバコモザイク病 (*Tabacco mosaic virus*)等の病害に
- 25 対して極めて高い防除効果を示すものである。

本発明の一般式(I) で表される置換アニリド誘導体を有効成分とする農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水

田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壤に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用薬剤は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

- 5 即ち、一般式(I) で表される置換アニリド誘導体はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、

- 10 固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類（例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等）、タルク類（例えばタルク、ピロフィライト等）、シリカ類（例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン（含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成
- 15 高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。））、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、燐酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以
- 20 上の混合物の形で使用される。

- 液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうるものとなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類（例
- 25 えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等）、エーテル類（例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等）、脂肪族炭化水素類（例えばケロシン、鉱油等）、芳香族炭化水素類（例

例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソブピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリル類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び/又は湿潤の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び/又は結合の目的のために、次に例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコン油等の補助剤を使用することもできる。

防腐剤としては、1, 2-ベンズイソチアゾリン-3-オン、パラクロロメタキシレノール、パラオキシ安息香酸ブチル等も添加することが出来る。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の添加剤も加えることが可能である。

- 有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、農園芸用殺虫
- 5 剤100重量部中、0.01～90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば粉剤又は粒剤とする場合は0.01～50重量%、又乳剤又は水和剤とする場合も同様0.01～50重量%が適当である。

- 本発明の農園芸用薬剤は各種病害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害虫防除に有効な量を当該病害虫の発生が
- 10 予測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

- 本発明の農園芸用薬剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001g
- ～10kg、好ましくは0.01g～1kgの範囲から目的に応じて適宜選択す
- 15 れば良い。

本発明の農園芸用薬剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又、使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

- 20 かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤としては、例えばエチオン、トリクロルホン、メタミドホス、アセフェート、ジクロルボス、メビンホス、モノクロトホス、マラチオン、ジメトエート、ホルモチオン、メカルバム、バミドチオン、チオメトン、ジスルホトン、オキシデプロホス、ナレド、メチルパラチオン、フェニトロチオン、シアノホス、プロパホス、フェンチオン、
- 25 プロチオホス、プロフェノホス、イソフェンホス、テメホス、フェントエート、ジメチルビンホス、クロルフェビンホス、テトラクロルビンホス、ホキシム、イソキサチオン、ピラクロホス、メチダチオン、クロロピリホス、クロルピリホス・メチル、ピリダフェンチオン、ダイアジノン、ピリミホスメチル、ホサロン、ホスメット、ジオキサベンゾホス、キナルホス、テルブホス、エトプロホス、カ

- ズサホス、メスルフェンホス、DPS (NK-0795)、ホスホカルブ、フェナミホス、イソアミドホス、ホスチアゼート、イサゾホス、エナプロホス、フェンチオン、ホスチエタン、ジクロフェンチオン、チオナジン、スルプロホス、フェンスルフォチオン、ジアミダホス、ピレトリン、アレスリン、プラレトリン、
- 5 レスメトリン、ペルメトリン、テフルトリン、ビフェントリン、フェンプロパトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、シハロトリン、ラムダ・シハロトリン、デルタメトリン、アクリナトリン、フェンパレレート、エスフェンパレレート、フルシトリネート、フルバリネート、シクロプロトリン、エトフェンプロックス、ハルフェンプロックス、シラフルオフェン、フルシトリネート、フ
- 10 ルバリネート、メソミル、オキサミル、チオジカルブ、アルジカルブ、アラニカルブ、カルタップ、メトルカルブ、キシリカルブ、プロボキスル、フェノキシカルブ、フェノブカルブ、エチオフェンカルブ、フェノチオカルブ、ビフェナゼート、BPMC、カルバリル、ピリミカーブ、カルボフラン、カルボスルファン、フラチオカルブ、ベンフラカルブ、アルドキシカルブ、ジアフェンチウロン、ジ
- 15 フルベンズロン、テフルベンズロン、ヘキサフルムロン、ノバルロン、ルフェヌロン、フルフェノクスロン、クロルフルアズロン、酸化フェンブタスズ、水酸化トリシクロヘキシルスズ、オレイン酸ナトリウム、オレイン酸カリウム、メトブレン、ハイドロブレン、ピナパクリル、アミトラズ、ジコホル、ケルセン、クロルベンジレート、フェニソプロモレート、テトラジホン、ペンスルタップ、ベン
- 20 ゾメート、テブフェノジド、メトキシフェノジド、クロマフェノジド、プロパルギット、アセキノシル、エンドスルファン、ジオフェノラン、クロルフェナピル、フェンピロキシメート、トルフェンピラド、フィプロニル、テブフェンピラド、トリアザメート、エトキサゾール、ヘキシチアゾクス、硫酸ニコチン、ニテンピラム、アセタミプリド、チアクロプリド、イミダクロプリド、チアメトキサム、
- 25 クロチアニジン、ニジノテフラン、フルアジナム、ピリプロキシフェン、ヒドラメチルノン、ピリミジフェン、ピリダベン、シロマジン、TPIC (トリプロピルイソシアヌレート)、ピメトロジン、クロフェンテジン、ブプロフェジン、チオシクラム、フェナザキン、キノメチオネート、インドキサカルブ、ポリナクチン複合体、ミルベメクチン、アバメクチン、エマメクチン・ベンゾエート、スピ

- ノサッド、BT（バチルス・チューリンゲンシス）、アザディラクチン、ロテノン、ヒドロキシプロピルデンブン、塩酸レバミゾール、メタム・ナトリウム、酒石酸モランテル、ダゾメット、トリクラミド、バストリア、モナクロスポリウム・フィマトパガム等の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤を例示することができ、
- 5 同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤としては、例えば硫黄、石灰硫黄合剤、塩基性硫酸銅、イプロベンホス、エディフェンホス、トルクロホス・メチル、チラム、ポリカーバメイト、ジネブ、マンゼブ、マンコゼブ、プロピネブ、チオファネート、チオファネートメチル、ペノミル、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、フラメトピル、
- 10 チフルザミド、メタラキシル、オキサジキシル、カルプロパミド、ジクロフルアニド、フルスルフアミド、クロロタロニル、クレソキシム・メチル、フェノキサニル（NNF-9425）、ヒメキサゾール、エクロメゾール、フルオルイミド、プロシミドン、ピンクロゾリン、イプロジオン、トリアジメホン、トリフルミゾール、ピテルタノール、トリフルミゾール、イプコナゾール、フルコナゾール、
- 15 プロピコナゾール、ジフェノコナゾール、ミクロブタニル、テトラコナゾール、ヘキサコナゾール、テブコナゾール、イミベンコナゾール、プロクロラズ、ペフラゾエート、シプロコナゾール、イソプロチオラン、フェナリモル、ピリメタニル、メパニピリム、ピリフェノックス、フルアジナム、トリホリン、ジクロメジン、アゾキシストロビン、チアジアジン、キャプタン、プロベナゾール、アシベ
- 20 ンゾフラール-S-メチル（CGA-245704）、フサライド、トリシクラゾール、ピロキロン、キノメチオネート、オキシリニック酸、ジチアノン、カスガマイシン、バリダマイシン、ポリオキシシン、ブラストサイジン、ストレプトマイシン等の農園芸用殺菌剤を例示することができ、同様に除草剤としては、例えば
- グリホサート、スルホセート、グルホシネート、ピアラホス、ブタミホス、エス
- 25 プロカルブ、プロスルホカルブ、ベンチオカーブ、ピリブチカルブ、アシュラム、リニュロン、ダイムロン、ベンスルフロン-メチル、シクロスルフアムロン、シノスルフロン、ピラゾスルフロンエチル、アジムスルフロン、イマゾスルフロン、テニルクロール、アラクロール、プレチラクロール、クロメプロップ、エトベンザニド、メフェナセツト、ペンディメタリン、ピフェノックス、アシフルオフエ

ン、ラクトフェン、シハロホップ・ブチル、アイオキシニル、プロモブチド、ア
ロキシジム、セトキシジム、ナプロパミド、インダノファン、ピラゾレート、ベ
ンゾフェナップ、ピラフルフェン・エチル、イマザピル、スルフェントラゾン、
5 カフェンストロール、ペントキサゾン、オキサゾアゾン、パラコート、ジクワッ
ト、ピリミノバック、シマジン、アトラジン、ジメタメトリン、トリアジフラム、
ベンフレセート、フルチアセツト・メチル、キザロホップ・エチル、ベンタゾン、
過酸化カルシウム等の除草剤を例示することができる。

又、生物農薬として、例えば核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus、
NPV)、顆粒病ウイルス (Granulosis virus、GV)、細胞質多角体病ウイルス
10 (Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ボックスウイルス
(Entomopox virus、EPV)等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・フィマト
パガム (Monacrosporium phymatophagum)、スタイナーネマ・カーポカプサエ
(Steinernema carpocapsae)、スタイナーネマ・クシダエ (Steinernema
kushidai)、パスツーリア・ペネトランス (Pasteuria penetrans)等の殺虫又
15 は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン
(Trichoderma lignorum)、アグロバクテリウム・ラジオブクター
(Agrobacterium radiobactor)、非病原性エルビニア・カロトボーラ
(Erwinia carotovora)、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis)等の殺
菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス
20 (Xanthomonas campestris)等の除草剤として利用される生物農薬などと混合し
て使用することにより、同様の効果が期待できる。

更に、生物農薬として例えばオンシツツヤコバチ (Encarsia formosa)、コレ
マンアブラバチ (Aphidius colemani)、ショクガタマバエ (Aphidoletes
aphidimyza)、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea)、ハモグリコマユバチ
25 (Dacnusa sibirica)、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis)、ククメ
リスカブリダニ (Amblyseius cucumeris)、ナミヒメハナカメムシ (Orius
sauteri)等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ (Beauveria
brongniartii)等の微生物農薬、(Z)-10-テトラデセニル=アセタート、
(E, Z)-4, 10-テトラデカジニエル=アセタート、(Z)-8-ドデセ

ニル＝アセタート、(Z)－11－テトラデセニル＝アセタート、(Z)－13－イコセン－10－オン、(Z)－8－ドデセニル＝アセタート、(Z)－11－テトラデセニル＝アセタート、(Z)－13－イコセン－10－オン、14－メチル－1－オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

- 5 以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例1.

	第1表乃至第4表記載の化合物	10部
10	キシレン	70部
	N－メチルピロリドン	10部
	ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部
	以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

15 製剤例2.

	第1表乃至第4表記載の化合物	3部
	クレー粉末	82部
	珪藻土粉末	15部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

20 製剤例3.

	第1表乃至第4表記載の化合物	5部
	ベントナイトとクレーの混合粉末	90部
	リグニンスルホン酸カルシウム	5部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

25 製剤例4.

	第1表乃至第4表記載の化合物	20部
	カオリンと合成高分散珪酸	75部
	ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	5部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

試験例 1. コナガ (*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼 2 日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第 1 表乃至第 4 表に記載の化合物を有効成分とする薬剤を 500 ppm に希釈した薬液に約 30 秒間浸漬し、風乾後に 25℃ の恒温室に静置した。薬液浸漬 6 日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1 区 10 頭 3 連制

無処理区孵化虫数－処理区孵化虫数

$$10 \quad \text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$$

判定基準. A . . . 死虫率 100%

B . . . 死虫率 99%～90%

15 C . . . 死虫率 89%～80%

D . . . 死虫率 79%～50%

上記試験の結果、B 以上の殺虫活性を示した化合物は 1-2, 1-4, 1-10, 1-14, 1-17, 1-20, 1-21, 1-26, 1-28, 1-33, 1-35, 1-41, 1-48, 1-52, 1-56～58, 1-65, 1-70, 1-73, 1-82, 1-103, 1-107, 1-108, 1-132, 1-133, 1-143, 1-145, 1-146, 1-163, 1-164, 3-2, 3-3, 3-4, 3-10, 3-12, 4-1, 4-4, 及び 4-5 であった。

試験例 2. チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.) に対する殺虫試験

25 第 1 表乃至第 4 表に記載の化合物を有効成分とする薬剤を 500 ppm に希釈した薬液にチャ葉を約 30 秒間浸漬し、風乾後に直径 9 cm のプラスチックシャーレに入れ、チャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度 70% の恒温室に静置した。接種 8 日後に生死虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、試験例 1 の判定基準に従って判定を行った。1 区 10 頭 3 連制

無処理区生存虫数－処理区生存虫数

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区生存虫数} - \text{処理区生存虫数}}{\text{無処理区生存虫数}} \times 100$$

5

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1-52, 1-60, 1-103, 3-12, 3-28, 3-30及び3-31であった。

試験例3. ナミハダニ(*Tetranychus urticae*) に対する殺ダニ試験

インゲン葉で直径2 cmのリーフディスクを作成し、湿潤濾紙上に置き、そこ
10 へ雌成虫を接種した後、第1表乃至第4表に記載の化合物を有効成分とする薬剤
を500 ppmに希釈した薬液50 mlをターンテーブル上で均一に散布し、散布
後25℃の恒温室に静置した。薬剤処理2日後に死亡虫数を調査し、試験例1
の判定基準に従って判定した。1区10頭2連制

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1-22, 1-23, 1-25,
15 1-26, 1-34, 1-39, 1-40, 1-51, 1-52, 1-54, 1-60～
62, 1-65, 1-70～73, 1-78, 1-81, 1-82, 1-103, 1-
104, 1-106～109, 1-119, 1-132, 1-143, 1-146,
3-13, 3-21, 3-30～32及び4-3であった。

試験例4. モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*) に対する殺虫試験

20 直径8 cm、高さ8 cmのプラスチックポットにハクサイを植え、モモアカア
ブラムシを繁殖させた後、第1表乃至第4表に記載の化合物を有効成分とする薬
剤を500 ppmに希釈した薬液を茎葉部に十分に散布した。風乾後、ポットを
温室内に静置し、薬剤散布6日後に各ハクサイに寄生しているモモアカアブラム
シ数を調査し、防除価を算出し、下記基準に従って判定を行った。

25

$$\text{防除価 (\%)} = 100 - \left[(T \times C_a) / (T_a \times C) \right] \times 100$$

T_a : 処理区の散布前寄生虫数

T : 処理区の散布後寄生虫数

C a : 無処理区の散布前寄生虫数

C : 無処理区の散布後寄生虫数

判定基準

- 5 A : 防除価100%
- B : 防除価99～90%
- C : 防除価89～80%
- D : 防除価79～50%

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1-4, 1-8, 1-25, 1-35, 1-41, 1-52, 1-65, 1-81, 1-87, 1-106～108, 1-146, 3-27, 3-13, 3-34及び4-1であった。

試験例5. オオムギうどんこ病に対する防除試験

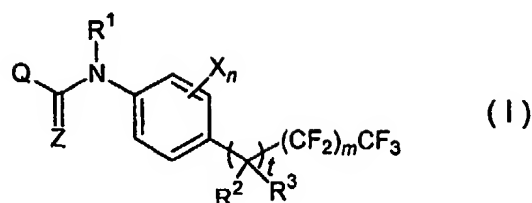
ポット植えのオオムギ(1葉期)にうどんこ病菌(*Erysiphe graminis hordei*)の孢子ふりかけて接種し、1日後に第1表、第3表又は第4表に記載の化合物を
 15 有効成分とする薬剤を200ppmに希釈した薬液を散布し、25℃の恒温室に静置した。接種1週間後にその病斑面積を調査し、無処理区と対比して下記の基準で防除効果を判定した。

- 判定基準 A : 防除価100～95%
- B : 防除価94～80%
- 20 C : 防除価79～60%
- D : 防除価59～0%

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1-5, 1-12, 1-23, 1-30, 1-45, 1-47, 1-52, 1-54, 1-83, 1-133, 3-30, 3-31及び4-3であった。

請求の範囲

1. 一般式(I)



- 5 {式中、 R^1 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

R^2 は水素原子、ハロゲン原子又はハロ C_1 - C_6 アルキル基を示す。

- 15 R^3 は水素原子、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_3 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_3 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ C_1 - C_3 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ C_1 - C_3 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル C_1 - C_3 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル C_1 - C_3 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_3 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_3 アルコキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ C_1 - C_3 アルコキシ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ C_1 - C_3 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ
- 20 C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、
- 25

- フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆
アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆ア
5 ルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキル
スルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ
基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシ
カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニ
ルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-
C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アル
10 コキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキ
ルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスル
ホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、
同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカル
ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニル
15 スルフィニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆
アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆ア
ルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキル
スルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ
20 基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシ
カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル
基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、
ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、
ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、
25 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆
アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキ
ルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆ア
ルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスル
ホニル基、フェニルC₁-C₆アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハ

ロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシ基を示す。

tは0または1を示し、mは0～6の整数を示す。

tが0のとき、Xは同一又は異なっても良く、 C_2-C_8 アルキル基、 C_1-C_8 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基又は同一若しくは異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基を示し、nは1～4の整数を示す。

tが1のとき、Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 C_1-C_8 アルキル基、ハロ C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、ハロ C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、ハロ C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_3-C_6 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_8 アルコキシ基、ハロ C_1-C_8 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基、 C_1-C_8 アルキルカルボニル基、ハロ C_1-C_8 アルキルカルボニル基、 C_1-C_8 アルキルチオカルボニル基、ハロ C_1-C_8 アルキルチオカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、

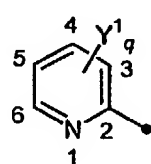
- ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示し、 n は1～4の整数を示す。

又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、

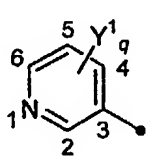
該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、Xは R^1 と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~8員環を形成することができる。

10 Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。

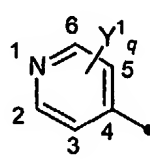
QはQ1~Q25で表される置換基を示す。



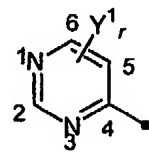
Q1



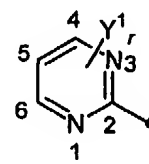
Q2



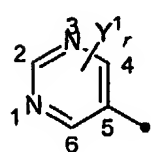
Q3



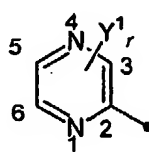
Q4



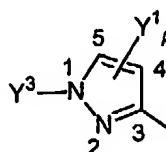
Q5



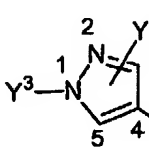
Q6



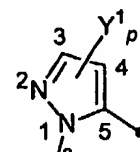
Q7



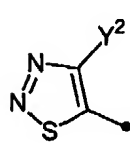
Q8



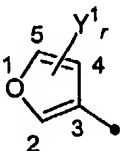
Q9



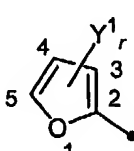
Q10



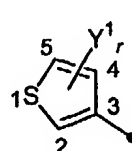
Q11



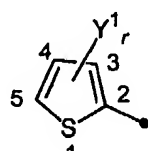
Q12



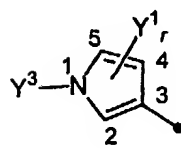
Q13



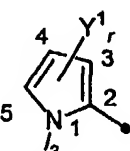
Q14



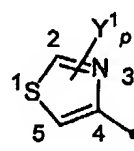
Q15



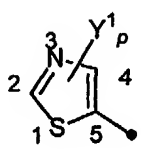
Q16



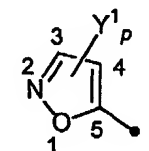
Q17



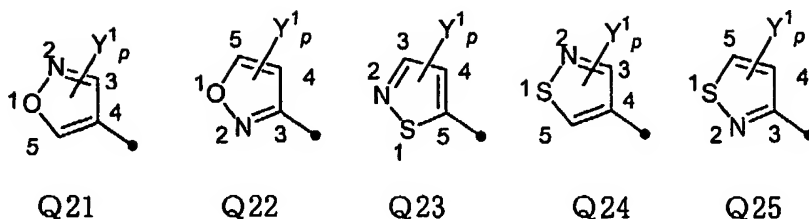
Q18



Q19



Q20



- (式中、 Y^1 は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_2 - C_6 アルケニル基、ハロ C_2 - C_6
- 5 アルケニル基、 C_2 - C_6 アルキニル基、ハロ C_2 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、フ
- 10 エニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、
- 15 同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィ
- 20 ニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、
- 25 ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ

C₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

- 又、芳香環上の隣接した2個のY¹は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
- 5 C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ
- 10 基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

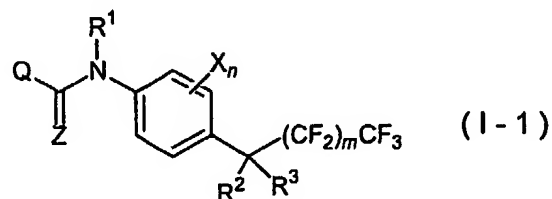
- Y²は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-
- 15 C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アル
- 20 キルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ
- 25 基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-

- C_6 アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、
- 5 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。
- 10 Y^3 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

p は 0 ~ 2 の整数を示し、q は 0 ~ 4 の整数を示し、r は 0 ~ 3 の整数を示す。) を示す。}

- 20 で表される置換アニリド誘導体。

2. 一般式(I-1)



{式中、 R^1 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニル基を示す。

- 25 R^2 は水素原子、ハロゲン原子又はハロ C_1 - C_6 アルキル基を示す。

R^3 は水素原子、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、

- シアノ基、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_3 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_3 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_3 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_3 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_3 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_3 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_3 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_3 アルコキシ基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_3 アルコキシ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_3 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基を示す。

mは0～6の整数を示す。

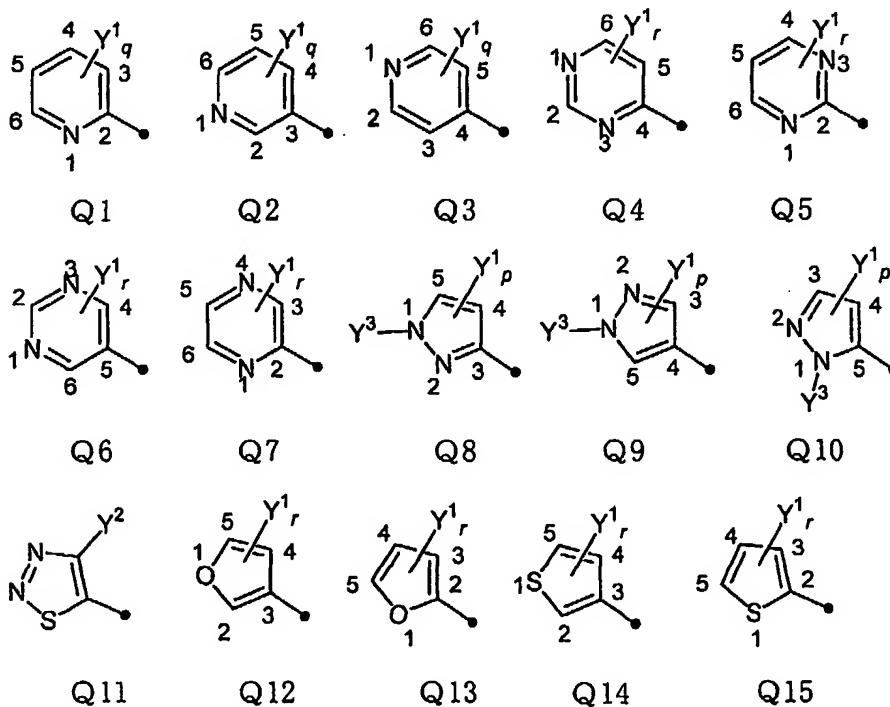
- Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 C_1-C_8 アルキル基、ハロ C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、ハロ C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、ハロ C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_3-C_6 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_8 アルコキシ基、ハロ C_1-C_8 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基、 C_1-C_8 アルキルカルボニル基、ハロ C_1-C_8 アルキルカルボニル基、 C_1-C_8 アルキルチオカルボニル基、ハロ C_1-C_8 アルキルチオカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 ア

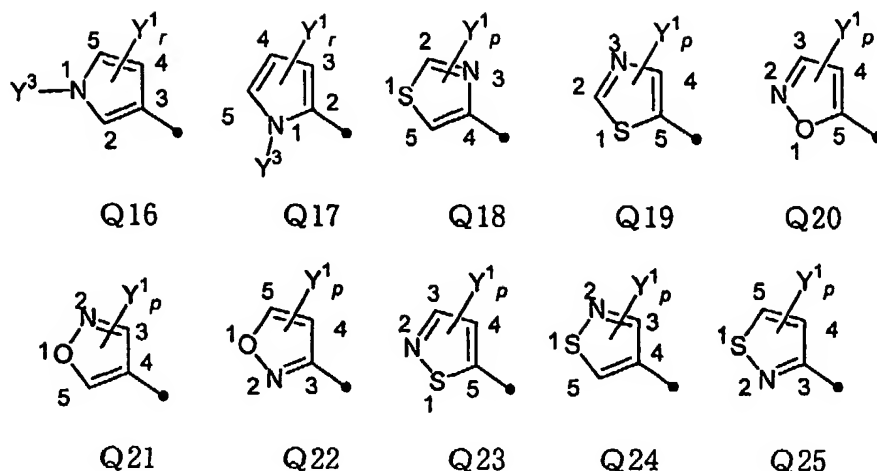
ルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示し、nは1～4の整数を示す。

又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、XはR¹と結合して、1～2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5～8員環を形成することができる。

Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。

QはQ1～Q25で表される置換基を示す。





- 5 (式中、 Y^1 は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_2 - C_6 アルケニル基、ハロ C_2 - C_6 アルケニル基、 C_2 - C_6 アルキニル基、ハロ C_2 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル
- 10 基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスル
- 15 ホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキ
- 20 ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異な
- 25 り選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若し

- くは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

- 又、芳香環上の隣接した2個の Y^1 は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

- Y^2 は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ

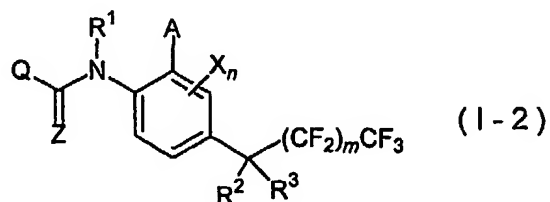
- 基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

- Y³は水素原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

pは0～2の整数を示し、qは0～4の整数を示し、rは0～3の整数を示す。)を示す。}

で表される置換アニリド誘導体。

25 3. 一般式(I-2)



{式中、 R^1 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基又はハロ C_1-C_6 アルキル基を示す。

R^2 は水素原子、ハロゲン原子又はハロ C_1-C_6 アルキル基を示す。

R^3 は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ
 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシアルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ
 5 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオアルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニ
 ルアルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアルコキシ基、モノ C_1-C_6 アルキ
 ルアミノアルコキシ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノアル
 コキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキ
 ルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスル
 10 ホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基を示す。

m は0～6の整数を示す。

A は C_3-C_8 アルキル基、ハロ C_3-C_8 アルキル基、 C_3-C_8 アルケニル基、ハロ
 C_3-C_8 アルケニル基、 C_3-C_8 アルキニル基、ハロ C_3-C_8 アルキニル基、 C_3-C_6
 シクロアルキル基、 C_3-C_6 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基、フェニル基、同
 15 一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル
 基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、
 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィ
 ニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、
 ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異
 20 なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基か
 ら選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

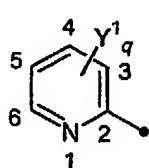
X は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 C_1-C_8 アルキル基、
 ハロ C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、ハロ C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8
 C_8 アルキニル基、ハロ C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_3-C_6
 25 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_8 アルコキシ基、ハロ C_1-C_8 アルコキシ
 シ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキ
 ルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6
 C_6 アルキルアミノ基、 C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6
 C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6

C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルキル基、モノC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₆アルキル基又は同一若しくは異なっても良いジ

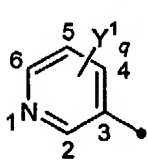
- 5 C₁-C₆アルキルアミノC₁-C₆アルキル基を示し、nは0～3の整数を示す。

Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。

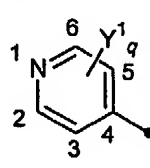
QはQ1～Q25で表される置換基を示す。



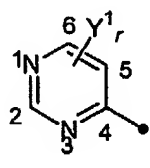
Q1



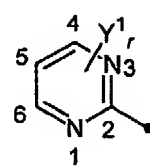
Q2



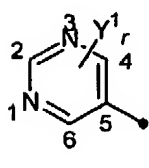
Q3



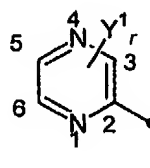
Q4



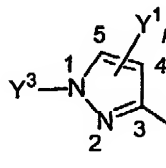
Q5



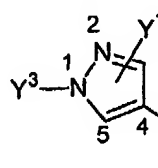
Q6



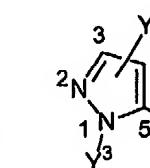
Q7



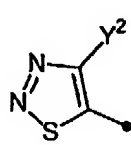
Q8



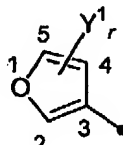
Q9



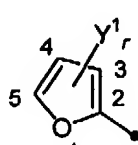
Q10



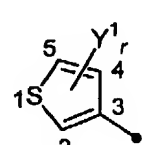
Q11



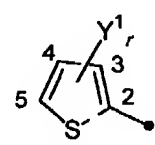
Q12



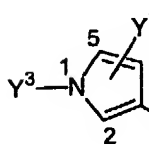
Q13



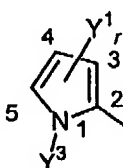
Q14



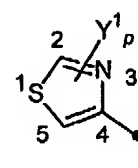
Q15



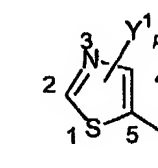
Q16



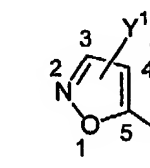
Q17



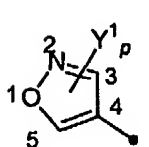
Q18



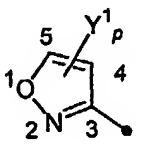
Q19



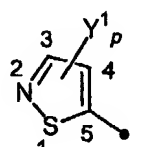
Q20



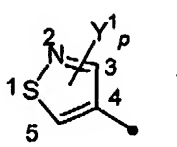
Q21



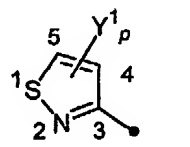
Q22



Q23



Q24



Q25

(式中、Y¹は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₂-C₆アルケニル基、ハロC₂-C₆

- アルケニル基、 C_2-C_6 アルキニル基、ハロ C_2-C_6 アルキニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

又、芳香環上の隣接した2個の Y^1 は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6

アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

Y^2 は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキル

ルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

- Y³は水素原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、フェニル基又は
 5 同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一
 10 又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

pは0～2の整数を示し、qは0～4の整数を示し、rは0～3の整数を示す。)を示す。}で表される置換アニリド誘導体。

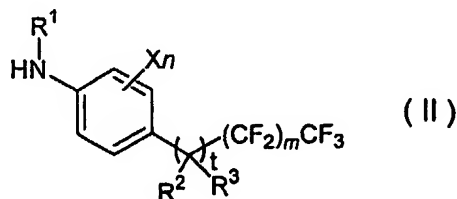
4. 一般式(I-2)において、R¹、R²、R³、A、X、Z、n、mは請
 15 求項3に同じくし、QがQ9、Q14、Q15である請求項3記載の置換アニリド誘導体。

5. 請求項1乃至4いずれか1項記載の置換アニリド誘導体を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用薬剤。

6. 農園芸用薬剤が農園芸用殺虫剤、殺菌剤又は殺ダニ剤である請求項5記載の農園芸用薬剤。
 20 載の農園芸用薬剤。

7. 有用植物から有害生物を防除するために、請求項5又は6いずれか1項記載の農園芸用薬剤の有効量を対象植物又は土壌に処理することを特徴とする農園芸用薬剤の使用方法。

8. 一般式(II)



25

(式中、R¹は水素原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、フェニ

ル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6
 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 ア
 ルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキル
 5 スルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ
 基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシ
 カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

R^2 は水素原子、ハロゲン原子又はハロ C_1-C_6 アルキル基を示す。

R^3 は水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、
 10 シアノ基、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6
 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ基、
 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アル
 コキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アル
 キルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アル
 15 コキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシ基、モノ C_1-C_6 ア
 ルキルアミノ C_1-C_6 アルコキシ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキル
 アミノ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ
 基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6
 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ
 20 C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基、
 フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6
 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 ア
 ルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキル
 25 スルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ
 基、同一又は異なっても良い C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシ
 カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニ
 ルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6
 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アル

- コキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカル
- 5 ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキル
- 10 スルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、
- 15 ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスル
- 20 ホニル基、フェニル C_1-C_6 アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシ基を示す。

tは1を示し、mは0から6の整数を示す。

Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 C_1-C_8 アルキル基、

- ハロC₁-C₈アルキル基、C₂-C₈アルケニル基、ハロC₂-C₈アルケニル基、C₂-C₈アルキニル基、ハロC₂-C₈アルキニル基、C₃-C₆シクロアルキル基、C₃-C₆シクロアルキルC₁-C₆アルキル基、C₁-C₈アルコキシ基、ハロC₁-C₈アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、C₁-C₆アルキルカルボニルC₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキルカルボニルC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルチオカルボニルC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルキル基、モノC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₆アルキル基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₆アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示し、nは1～4の整数を示す。
- 20 又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。)で表される置換アニリン誘導体。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/05285

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
Int.Cl ⁷ C07D231/14, 213/81, 285/06, 239/28, 307/68, 277/56, 261/18, 275/02, 333/40, 207/416, 213/82, 333/38, C07C211/52, 215/68, 217/76, A01N37/22, 43/40, 43/56		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
Int.Cl ⁷ C07D231/14, 213/81, 285/06, 239/28, 307/68, 277/56, 261/18, 275/02, 333/40, 207/416, 213/82, 333/38, C07C211/52, 215/68, 217/76, A01N37/22, 43/40, 43/56		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)		
CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 01/23356 A (Bayer AG), 05 April, 2001 (05.04.01), Patentansprüche & DE 19946852 A	1-8
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.		
<p>* Special categories of cited documents:</p> <p>"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>"E" earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</p> <p>"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p> <p>"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</p> <p>"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone</p> <p>"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art</p> <p>"&" document member of the same patent family</p>		
Date of the actual completion of the international search 04 July, 2002 (04.07.02)		Date of mailing of the international search report 16 July, 2002 (16.07.02)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer
Facsimile No.		Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D231/14, 213/81, 285/06, 239/28, 307/68, 277/56, 261/18, 275/02, 333/40, 207/416, 213/82, 333/38, C07C211/52, 215/68, 217/76, A01N37/22, 43/40, 43/56

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D231/14, 213/81, 285/06, 239/28, 307/68, 277/56, 261/18, 275/02, 333/40, 207/416, 213/82, 333/38, C07C211/52, 215/68, 217/76, A01N37/22, 43/40, 43/56

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	WO 01/23356 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT) 200 1. 04. 05, Patentansprüche & DE 19946852 A	1-8

☐ C欄の続きにも文献が列举されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

04. 07. 02

国際調査報告の発送日

16.07.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

内藤 伸一

4 P

8615

電話番号 03-3581-1101 内線 3492